

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

GEÄNDERTE FASSUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
29. Juli 2004 (29.07.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/062657 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/198,
31/401, 31/435, A61P 7/02, 9/00, 9/02, 9/10, 37/00, 37/08,
43/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/000247

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. Januar 2004 (15.01.2004)

(25) Elnreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 01 300.8 15. Januar 2003 (15.01.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): CURACYTE CHEMISTRY GMBH [DE/DE];
Winzerlaer Strasse 2a, 07745 Jena (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): STÜRZEBECHER,
Jörg [DE/DE]; Hubertusstrasse 38, 99094 Erfurt (DE).
STEINMETZER, Torsten [DE/DE]; Ricarda-Huch-Weg
23, 07743 Jena (DE). SCHWEINITZ, Andrea [DE/DE];
Mühlenstrasse 43, 07745 Jena (DE).

(74) Anwalt: BÖSL, Raphael; Prinzregentenstr. 68, 81675
München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des geänderten
internationalen Recherchenberichts: 6. Januar 2005

(15) Informationen zur Berichtigung:
siehe PCT Gazette Nr. 01/2005 vom 6. Januar 2005, Sec-
tion II

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: ACYLATED 4-AMIDINO- AND 4-GUANIDINO BENZYLAMINES FOR THE INHIBITION OF PLASMA
KALLIKREIN

(54) Bezeichnung: ACYLIERTEN 4-AMIDINO- UND 4-GUANIDINO BENZYLAMINEN ZUR INHIBIERUNG VON PLAS-
MAKALLIKREIN

(57) Abstract: The invention relates to the use of acylated 4-amidino- or 4-guanidinobenzylamines of general formula (I):
P4-P3-P2-P1, where P4 is a mono- or poly-substituted or unsubstituted benzylsulphonyl group, P3 is a mono- or poly-substituted or
unsubstituted, natural or unnatural α -amino or α -imino acid with the D-configuration, P2 is a mono- or poly-substituted or unsubsti-
tuted natural or unnatural α -amino or α -imino acid with the L-configuration and P1 is a mono- or poly-substituted or unsubstituted
4-amidino- or 4-guanidinobenzylamine group, for the inhibition of plasma kallikrein (PK), factor XIa and factor XIIa, in particular
for the prevention of coagulation activation on synthetic surfaces and for systemic dosage as anticoagulants/antithrombotics, above
all for prevention of coagulation activation on synthetic surfaces to prevent thromboembolic events.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft die Verwendung von acyliertem 4-Amidino- oder 4-Guanidinobenzylamin gemäß
der allgemeinen Formel (I): P4-P3-P2-P1, wobei P4 eine einfach oder mehrfach substituierte oder unsubstituierte Benzylsulfonyl-
gruppe ist, P3 eine einfach oder mehrfach substituierte oder unsubstituierte, natürliche oder unnatürliche α -Amino- oder α -Imi-
nosäure in der D-Konfiguration ist, P2 eine einfach oder mehrfach substituierte oder unsubstituierte, natürliche oder unnatürliche
 α -Amino- oder α -Iminosäure in der L-Konfiguration ist, und P1 eine einfach oder mehrfach substituierte oder unsubstituierte 4-Ami-
dino- oder 4-Guanidino-benzylamingruppe ist, zur Inhibierung von Plasmakallikrein (PK), Faktor XIa und Faktor XIIa, insbesondere
zur Verhinderung der Gerinnungsaktivierung an künstlichen Oberflächen und zur systemischen Gabe als Antikoagulanzen/Anti-
thrombotika, vor allem zur Verhinderung der Gerinnungsaktivierung an künstlichen Oberflächen zur Vorbeugung thromboemboli-
scher Ereignisse.

WO 2004/062657 A1



Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

CORRECTED VERSION

International Application No

PCT/EP2004/000247

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A61K31/198 A61K31/401 A61K31/435 A61P7/02 A61P9/00
A61P9/02 A61P9/10 A61P37/00 A61P37/08 A61P43/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data, MEDLINE, BIOSIS, EMBASE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|---|----------------------------|
| X | <p>WO 02/062829 A (HARAMURA MASAYUKI ; KOGA TAKAKI (JP); SATO HARUHIKO (JP); KADONO SHOJI) 15 August 2002 (2002-08-15) abstract & EP 1 364 960 A (CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD) 26 November 2003 (2003-11-26) abstract page 3, line 19 - page 7, line 41 examples 1-182 claims 1-30</p> <p>----- -/--</p> | <p>8-33, 37-45</p> |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

18 May 2004

Date of mailing of the international search report

18. 08. 2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Taylor, G.M.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

CORRECTED VERSION

International Application No

PCT/EP2004/000247

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X | WO 02/14349 A (LEVY ODILE ESTHER ; WEINHOUSE MICHAEL I (US); CORVAS INT INC (US); MAD) 21 February 2002 (2002-02-21) abstract page 1, line 11 - line 20 page 4, line 23 - page 5, line 29 page 9, line 1 - line 9 examples 1-110,A-C claims 1-87 figures 1-17 | 8-33, 37-45 |
| X | ----- KÜNZEL, S; SCHWEINITZ, A; REISSMANN, S; STUERZEBECKER, J; STEINMETZER, T: "4-Amidinobenzylamine-Based Inhibitors of Urokinase" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, vol. 12, 2002, pages 645-648, XP002193207 ISSN: 0960-894X abstract tables 1-3 | 8-33, 37-45 |
| P,X | ----- WO 03/076391 A (SCHWEINITZ ANDREA ; STEINMETZER TORSTEN (DE); STUERZEBECKER JOERG (DE)) 18 September 2003 (2003-09-18) abstract page 12, line 16 - page 20, line 23 examples 1-10 claims 1-20 | 8-33, 37-45 |
| P,X | ----- WO 03/076457 A (SCHWEINITZ ANDREA ; STEINMETZER TORSTEN (DE); STUERZEBECKER JOERG (DE)) 18 September 2003 (2003-09-18) abstract page 1, line 3 - line 5 examples 1-8 claims 1-15 | 8-33, 37-45 |
| P,X | ----- DE 102 12 555 A (TECH UNI MUENCHEN ; UNIV SCHILLER JENA (DE)) 25 September 2003 (2003-09-25) the whole document | 8-33, 37-45 |
| A | ----- STUERZEBECKER, J; PRASA, D; WIKSTROEM, P; VIEWEG, H: "Novel plasma kallikrein inhibitors of the benzamidine type" BRAZILIAN J MED BIOL RES, vol. 27, 1994, pages 1929-1934, XP009030092 abstract tables 1,2 ----- | 8-33, 37-45 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2004/000247

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 1-26, 34-36
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☒ Claims Nos.: 1-7, 34-36
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
See annex PCT/ISA/210
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

Continuation of Box II.1

Although claims 1 to 26 relate to a method for treatment of the human or animal body, the search was carried out and was based on the stated effects of the compound or composition.

Continuation of Box II.2

Claims 1-7 and 34-36

The current claims 1 to 7, 35 and 36 relate to an inordinately large number of possible compounds/products, of which only a small proportion are supported by the description in accordance with PCT Article 6 and/or can be regarded as having been disclosed in the application in accordance with PCT Article 5. In the present case the claims lack the proper support and the application lacks the requisite disclosure to such an extent that it appears impossible to carry out a meaningful search covering the entire range of protection sought. The search was therefore directed to the parts of the claims that appear to be supported and disclosed in the above sense, that is the compounds/products claimed in claim 8.

The current claim 34 relates to a product/method characterised by a desirable attribute or property, namely:

"... characterised in that the product is used to inhibit other trypsin-like serine proteases"

The claims therefore encompass all products, etc., that have this attribute or property, yet only a limited number of such products, etc. have adequate support in the description (PCT Article 5). In the present case the claims lack the proper support and the application lacks the requisite disclosure to such an extent that it appears impossible to carry out a meaningful search covering the entire range of protection sought.

Irrespective of this, the claims also lack the requisite clarity (PCT Article 6) since they attempt to define the product/method/compound/device in terms of the results which are to be achieved. This lack of clarity too is such that it is impossible to carry out a meaningful search covering the entire range of protection sought.

Moreover, the term "other trypsin-like serine proteases" is unclear.

Consequently no search was carried out in respect of this claim.

The applicant is advised that claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established cannot normally be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). In its capacity as International

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2004/000247

Preliminary Examining Authority the EPO generally will not carry out a preliminary examination for subjects that have not been searched. This also applies to cases where the claims were amended after receipt of the international search report (PCT Article 19) or where the applicant submits new claims in the course of the procedure under PCT Chapter II. After entry into the regional phase before the EPO, however, an additional search may be carried out in the course of the examination (cf. EPO Guidelines, Part C, VI, 8.5) if the defects that led to the declaration under PCT Article 17(2) have been remedied.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

CORRECTED VERSION

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/000247

| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---|---------------------|--|--|
| WO 02062829 | A | 15-08-2002 | EP 1364960 A1 WO 02062829 A1 US 2004087511 A1 | 26-11-2003 15-08-2002 06-05-2004 |
| EP 1364960 | A | 26-11-2003 | EP 1364960 A1 US 2004087511 A1 WO 02062829 A1 | 26-11-2003 06-05-2004 15-08-2002 |
| WO 0214349 | A | 21-02-2002 | US 2002037857 A1 AU 8334701 A CA 2387002 A1 JP 2004506648 T WO 0214349 A2 EP 1182207 A2 ZA 200202825 A | 28-03-2002 25-02-2002 21-02-2002 04-03-2004 21-02-2002 27-02-2002 10-07-2003 |
| WO 03076391 | A | 18-09-2003 | DE 10210592 A1 WO 03076391 A2 | 02-10-2003 18-09-2003 |
| WO 03076457 | A | 18-09-2003 | DE 10210590 A1 WO 03076457 A1 | 02-10-2003 18-09-2003 |
| DE 10212555 | A | 25-09-2003 | DE 10212555 A1 | 25-09-2003 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

BERICHTIGTE FASSUNG

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/000247

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

| | | | | | |
|-------|------------|------------|------------|-----------|-----------|
| IPK 7 | A61K31/198 | A61K31/401 | A61K31/435 | A61P7/02 | A61P9/00 |
| | A61P9/02 | A61P9/10 | A61P37/00 | A61P37/08 | A61P43/00 |

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data, MEDLINE, BIOSIS, EMBASE

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|---------------------------|
| X | <p>WO 02/062829 A (HARAMURA MASAYUKI ; KOGA TAKAKI (JP); SATO HARUHIKO (JP); KADONO SHOJI) 15. August 2002 (2002-08-15)</p> <p>Zusammenfassung</p> <p>& EP 1 364 960 A (CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD) 26. November 2003 (2003-11-26)</p> <p>Zusammenfassung</p> <p>Seite 3, Zeile 19 - Seite 7, Zeile 41</p> <p>Beispiele 1-182</p> <p>Ansprüche 1-30</p> <p style="text-align: center;">-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p> | <p>8-33,</p> <p>37-45</p> |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

18. Mai 2004

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

18. 08. 2004

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Taylor, G.M.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/000247

BERICHTIGTE FASSUNG

| C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN | | |
|--|--|---------------------|
| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Beir. Anspruch N°r. |
| X | <p>WO 02/14349 A (LEVY ODILE ESTHER ; WEINHOUSE MICHAEL I (US); CORVAS INT INC (US); MAD) 21. Februar 2002 (2002-02-21)</p> <p>Zusammenfassung Seite 1, Zeile 11 - Zeile 20 Seite 4, Zeile 23 - Seite 5, Zeile 29 Seite 9, Zeile 1 - Zeile 9 Beispiele 1-110,A-C Ansprüche 1-87 Abbildungen 1-17</p> | 8-33, 37-45 |
| X | <p>KÜNZEL, S; SCHWEINITZ, A; REISSMANN, S; STUERZEBECKER, J; STEINMETZER, T: "4-Amidinobenzylamine-Based Inhibitors of Urokinase" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, Bd. 12, 2002, Seiten 645-648, XP002193207 ISSN: 0960-894X Zusammenfassung Tabellen 1-3</p> | 8-33, 37-45 |
| P,X | <p>WO 03/076391 A (SCHWEINITZ ANDREA ; STEINMETZER TORSTEN (DE); STUERZEBECKER JOERG (DE)) 18. September 2003 (2003-09-18) Zusammenfassung Seite 12, Zeile 16 - Seite 20, Zeile 23 Beispiele 1-10 Ansprüche 1-20</p> | 8-33, 37-45 |
| P,X | <p>WO 03/076457 A (SCHWEINITZ ANDREA ; STEINMETZER TORSTEN (DE); STUERZEBECKER JOERG (DE)) 18. September 2003 (2003-09-18) Zusammenfassung Seite 1, Zeile 3 - Zeile 5 Beispiele 1-8 Ansprüche 1-15</p> | 8-33, 37-45 |
| P,X | <p>DE 102 12 555 A (TECH UNI MUENCHEN ; UNIV SCHILLER JENA (DE)) 25. September 2003 (2003-09-25) das ganze Dokument</p> | 8-33, 37-45 |
| A | <p>STUERZEBECKER, J; PRASA, D; WIKSTROEM, P; VIEWEG, H: "Novel plasma kallikrein inhibitors of the benzamidine type" BRAZILIAN J MED BIOL RES, Bd. 27, 1994, Seiten 1929-1934, XP009030092 Zusammenfassung Tabellen 1,2</p> | 8-33, 37-45 |

Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☒ Ansprüche Nr. **1-26, 34-36**
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
Obwohl die Ansprüche 1-26 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung/Zusammensetzung.
2. ☒ Ansprüche Nr. **1-7, 34-36**
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
siehe BEIBLATT PCT/ISA/210
3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld II.1

Obwohl die Ansprüche 1-26 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung/Zusammensetzung.

Fortsetzung von Feld II.2

Ansprüche Nr.: 1-7,34-36

Die geltenden Patentansprüche 1-7, 35 und 36 beziehen sich auf eine unverhältnismässig grosse Zahl möglicher Verbindungen/Produkte, von denen sich nur ein kleiner Anteil im Sinne von Artikel 6 PCT auf die Beschreibung stützen und/oder als im Sinne von Artikel 5 PCT in der Patentanmeldung offenbart gelten kann. Im vorliegenden Fall fehlt den Patentansprüchen die entsprechende Stütze und fehlt der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Masse, dass eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, welche im o.a. Sinne als gestützt und offenbart erscheinen, nämlich die Teile betreffend, die Verbindungen/Produkte wie im Patentanspruch 8 beansprucht werden.

Der geltende Patentanspruch 34 bezieht sich auf ein Produkt/Verfahren, jeweils charakterisiert durch eine erstrebenswerte Eigenheit oder Eigenschaft, nämlich

"... dadurch gekennzeichnet, dass [das Produkt] zur Inhibierung weiterer trypsinartiger Serinproteasen ... verwendet wird".

Die Patentansprüche umfassen daher alle Produkte etc., die diese Eigenheit oder Eigenschaft aufweisen, wohingegen die Patentanmeldung Stütze durch die Beschreibung im Sinne von Artikel 5 PCT nur für eine begrenzte Zahl solcher Produkte etc. liefert. Im vorliegenden Fall fehlen den Patentansprüchen die entsprechende Stütze bzw. der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Masse, dass eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint.

Desungeachtet fehlt den Patentansprüchen auch die in Artikel 6 PCT geforderte Klarheit, nachdem in ihnen versucht wird, das Produkt/Verfahren/die Verbindung/Vorrichtung über das jeweils erstrebte Ergebnis zu definieren. Auch dieser Mangel an Klarheit ist dergestalt, dass er eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich macht.

Darüber hinaus ist der Begriff "weiterer trypsinartiger Serinproteasen" unklar.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Demzufolge wurde eine Recherche für diesen Anspruch nicht durchgeführt.

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, dass Patentansprüche auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit, der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, dass die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, dass der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäss Kapitel II PCT neue Patentanprüche vorlegt. Nach Eintritt in die regionale Phase vor dem EPA kann jedoch im Zuge der Prüfung eine weitere Recherche durchgeführt werden (Vgl. EPA-Richtlinien C-VI, 8.5), sollten die Mängel behoben sein, die zu der Erklärung gemäss Art. 17 (2) PCT geführt haben.

BERICHTIGTE FASSUNG

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/000247

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | | Datum der Veröffentlichung | | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|---|-------------------------------|----|-----------------------------------|-------------------------------|
| WO 02062829 | A | 15-08-2002 | EP | 1364960 A1 | 26-11-2003 |
| | | | WO | 02062829 A1 | 15-08-2002 |
| | | | US | 2004087511 A1 | 06-05-2004 |
| ----- | | | | | |
| EP 1364960 | A | 26-11-2003 | EP | 1364960 A1 | 26-11-2003 |
| | | | US | 2004087511 A1 | 06-05-2004 |
| | | | WO | 02062829 A1 | 15-08-2002 |
| ----- | | | | | |
| WO 0214349 | A | 21-02-2002 | US | 2002037857 A1 | 28-03-2002 |
| | | | AU | 8334701 A | 25-02-2002 |
| | | | CA | 2387002 A1 | 21-02-2002 |
| | | | JP | 2004506648 T | 04-03-2004 |
| | | | WO | 0214349 A2 | 21-02-2002 |
| | | | EP | 1182207 A2 | 27-02-2002 |
| | | | ZA | 200202825 A | 10-07-2003 |
| ----- | | | | | |
| WO 03076391 | A | 18-09-2003 | DE | 10210592 A1 | 02-10-2003 |
| | | | WO | 03076391 A2 | 18-09-2003 |
| ----- | | | | | |
| WO 03076457 | A | 18-09-2003 | DE | 10210590 A1 | 02-10-2003 |
| | | | WO | 03076457 A1 | 18-09-2003 |
| ----- | | | | | |
| DE 10212555 | A | 25-09-2003 | DE | 10212555 A1 | 25-09-2003 |
| ----- | | | | | |